

セロトニン再吸収阻害剤 [^3H] 6-Nitroquipazine の合成

橋本謙二, 五郎丸 毅

RADIOISOTOPES 39 : 168 - 169 (1990).

Preparation of [^3H] 6-Nitroquipazine, a Potent and Selective 5-Hydroxytryptamine Uptake Inhibitor

Kenji HASHIMOTO and Tsuyoshi GOROMARU

ABSTRACT The synthesis of 6-nitroquipazine, a very potent and selective 5-hydroxytryptamine (5-HT; serotonin) uptake inhibitor, labeled with tritium is described. High specific activity [^3H] 6-nitroquipazine could be prepared by the nitration of [^3H] quipazine using a mixture of equal volumes of sulfuric acid and nitric acid. The radiochemical yield was approximately 50% based on [^3H] quipazine. The radiochemical purity was more than 95% from high performance liquid chromatography (HPLC) and thin layer chromatography (TLC) determinations. [^3H] 6-Nitroquipazine would be a new suitable radioligand for studying 5-HT transporter complex in brain and platelets.

抄録 強力でかつ選択的なセロトニン再吸収阻害作用を有する 6-nitroquipazine のトリチウム標識を行った。 [^3H] 6-Nitroquipazine は [^3H] quipazine のニトロ化反応によって合成した。放射化学的収率は約50%であった。放射化学的純度は、HPLCおよびTLCで求めたところ、95%以上であった。 [^3H] 6-Nitroquipazine は、脳および血小板におけるセロトニントランスポーターの研究に有用なラジオリガンドになるであろう。